

**METHOD OF PREPARING ALKALI AND ALKALI-EARTH  
SALTS OF 5-AMINO-2,3-DIHYDRO-1,4-  
PHTHALAZINEDIONE****Publication number:** RU2169139 (C1)**Publication date:** 2001-06-20**Inventor(s):** ZHILOV V KH**Applicant(s):** TS SOVREMENNOJ MEDITSINY MEDIK**Classification:****- international:** C07C237/32; C07C237/00; (IPC1-7): C07C237/32**- European:****Application number:** RU20000120331 20000802**Priority number(s):** RU20000120331 20000802**Abstract of RU 2169139 (C1)**

organic chemistry, more particularly preparation of aminodilydrophthalazinedione salts used as anti-inflammatory, antitoxic and immunocorrecting agents in medicine. SUBSTANCE: described is method of preparing alkali or alkali-earth salts of 5-amino-2,3-dihydro-1,4-phthalazinedione by reacting 5-amino-2,3-dihydro-1,4-phthalazinedione with alkali or alkali-earth metal alcoholates during heating operation. EFFECT: higher yield of the desired products. 3 ex

Data supplied from the **esp@cenet** database — Worldwide



(19) RU<sup>(11)</sup> 2 169 139<sup>(13)</sup> C1  
(51) МПК<sup>7</sup> C 07 C 237/32

РОССИЙСКОЕ АГЕНТСТВО  
ПО ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ РОССИЙСКОЙ  
ФЕДЕРАЦИИ

(21), (22) Заявка: 2000120331/04, 02.08.2000

(24) Дата начала действия патента: 02.08.2000

(43) Дата публикации заявки: 20.06.2001

(46) Дата публикации: 20.06.2001

(56) Ссылки: RU 2130775 C, 27.05.1999. US 4011219 A, 08.03.1977. US 3963716 A, 15.06.1976. RU 94026299 A, 27.05.1996. SU 130903 A, 21.11.1959.

(98) Адрес для переписки:  
121374, Москва, ул. Алексея Свиридова, 15,  
корп.3, ЗАО "Медикор", В.Х.Жилову

(71) Заявитель:

Закрытое акционерное общество "Центр современной медицины "Медикор"

(72) Изобретатель: Жиров В.Х.

(73) Патентообладатель:

Закрытое акционерное общество "Центр современной медицины "Медикор"

(54) СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ ЩЕЛОЧНЫХ И ЩЕЛОЧНОЗЕМЕЛЬНЫХ СОЛЕЙ  
5-АМИНО-2,3-ДИГИДРО-1,4-ФТАЛАЗИДИОНА

(57) Реферат:

Изобретение относится к органической химии, непосредственно к способам получения солей аминодицидифталазиндиона, применяемых в медицине в качестве противовоспалительных, антиоксидантических, иммуно-корректирующих средств. Сущность изобретения: способ

получения щелочных или щелочноземельных солей 5-амино-2,3-дигидро-1,4-фталазиндиона взаимодействием 5-амино-2,3-дигидро-1,4-фталазиндиона с алкохолятами щелочных или щелочноземельных металлов при нагревании. Технический результат - более высокий выход целевых продуктов.

RU 2 169 139 C 1

RU 2 169 139 C 1



(19) **RU**<sup>(11)</sup> **2 169 139**<sup>(13)</sup> **C1**  
(51) int. Cl.<sup>7</sup> **C 07 C 237/32**

RUSSIAN AGENCY  
FOR PATENTS AND TRADEMARKS

(12) **ABSTRACT OF INVENTION**

(21), (22) Application: 2000120331/04, 02.08.2000

(24) Effective date for property rights: 02.08.2000

(43) Application published: 20.06.2001

(46) Date of publication: 20.06.2001

(98) Mail address:  
121374, Moskva, ul. Alekseja Sviridova, 15,  
korp.3, ZAO "Medikor", V.Kh.Zhilovu

(71) Applicant:  
Zakrytoe aktsionernoe obshchestvo "Tsentr  
sovremennoj meditsiny "Medikor"

(72) Inventor: Zhilov V.Kh.

(73) Proprietor:  
Zakrytoe aktsionernoe obshchestvo "Tsentr  
sovremennoj meditsiny "Medikor"

(54) METHOD OF PREPARING ALKALI AND ALKALI-EARTH SALTS OF  
5-AMINO-2,3-DIHYDRO-1,4-PHTHALAZINEDIONE

(57) Abstract  
FIELD: organic chemistry, more  
particularly preparation of  
aminodihydrophthalazinedione salts used as  
anti-inflammatory, antitoxic and  
immunocorrecting agents in medicine.  
SUBSTANCE: described is method of preparing

alkali or alkali-earth salts of 5-  
amino-2,3-dihydro-1,4-phthalazinedione by  
reacting 5-amino-2,3-  
dihydro-1,4-phthalazinedione with alkali or  
alkali-earth metal alcoholates during  
heating operation. EFFECT: higher yield of  
the desired products. 3 ex

RU 2 169 139 C1

RU 2 169 139 C1

Изобретение относится к органической химии, а именно к способам получения производных 5-амино-2,3-дигидро-1,4-фталазиндиона, применяемых в качестве противовоспалительных, антикоагуляционных, иммунокорректирующих средств.

Известен способ получения 5-амино-2,3-дигидрофталазин-1,4-диона (лиоминла) восстановлением 3-нитрофталевой кислоты гидразингидратом в водной среде на светлом никелевом катализаторе с последующим упариванием раствора и нагреванием при 120°C в присутствии гидразингидрата и уксусной кислоты (СССР, авт. свид. N 13093, 1960). Известен также способ получения аналога лиоминла, а именно дигидрата натриевой соли

2-амино-1,2,3,4-тетрагидрофталазин-1,4-диона, получаемого путем нагрева на водяной бане смеси 2-нитрофталгидрида и раствора NaOH в дистиллированной воде в присутствии катализатора никель-алюминиевого сплава (РФ, патент N 2113222, А 61 К 31/04, 1977).

Наиболее близким по технической сущности является способ получения дигидрата натриевой соли 5-амино-2,3-дигидрофталазин-1,4-диона взаимодействием

5-амино-2,3-дигидрофталазин-1,4-диона с едким натром в водной среде (РФ, патент N 2107775, А 61 К 31/495, 1999).

Все цитируемые известные способы протекают с достаточно высокими выходами целевых продуктов, однако из-за длительного кипячения водных растворов конечные продукты сильно загрязнены побочными труднорастворимыми продуктами окисления, что отрицательно сказывается на потребительских свойствах, особенно при применении указанных веществ в медицине.

Данное изобретение представляет собой способ получения щелочных и

щелочноземельных солей 5-амино-2,3-дигидро-1,4-фталазиндиона взаимодействием с алколатами соответствующих металлов в безводной спиртовой среде при нагревании 5-амино-2,3-дигидро-1,4-фталазиндиона.

Новое изобретение отличается от способа-прототипа как исходными соединениями, так и средой, в которой осуществляется процесс. Применение в качестве исходных алколатов металлов и проведение процесса в безводной среде при нагревании позволяют избежать образования нежелательных побочных продуктов окисления. Исходные продукты в новом способе вводятся в эквимолекулярных количествах. В качестве исходных алколатов применяются низшие алколаты натрия, калия, лития, кальция, бария, предпочтительно этилаты и изопропилаты. Процесс осуществляется при повышенной температуре в пределах 75 - 80°C.

Структуры полученных соединений подтверждены данными элементного анализа, ИК- и УФ-спектроскопии.

Изобретение иллюстрируется следующими примерами.

Пример 1. Натриевая соль 5-амино-2,3-дигидро-1,4-фталазиндиона.

В четырехгорлую колбу, снабженную мешалкой, термометром, обратным холодильником, загружают 400 мл абсолютного этилового спирта, 5,6 г (0,14 моль) порошкообразного NaOH, нагревают до 78°C при перемешивании, затем добавляют порциями в течение 1,5 ч 24,7 г (0,14 моль)

5-амино-2,3-дигидро-1,4-фталазиндиона.

После окончания загрузки продолжают кипячение реакционной массы в течение 3 ч. Суспензию охлаждают до 0°C, осадок отфильтровывают и сушат до постоянной массы. Получают 25,6 г белых с бежеватым оттенком кристаллов с т. пл. выше 300°C.

Выход 92,4%, считая на загруженный 5-амино-2,3-дигидро-1,4-фталазиндion. Найдено, %: С 48,27; Н 3,12; N 21,25;  $C_{16}H_{16}N_2O_2$ . Вычислено, %: С 48,24; Н 3,02; N 21,10.

Пример